

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(Chapter I of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Rule 44bis)

Applicant's or agent's file reference 0000055259	FOR FURTHER ACTION		See item 4 below
International application No. PCT/EP2005/000257	International filing date (<i>day/month/year</i>) 13 January 2005 (13.01.2005)	Priority date (<i>day/month/year</i>) 15 January 2004 (15.01.2004)	
International Patent Classification (8th edition unless older edition indicated) See relevant information in Form PCT/ISA/237			
Applicant BASF Aktiengesellschaft			

1. This international preliminary report on patentability (Chapter I) is issued by the International Bureau on behalf of the International Searching Authority under Rule 44 *bis*.1(a).

2. This REPORT consists of a total of 9 sheets, including this cover sheet.

In the attached sheets, any reference to the written opinion of the International Searching Authority should be read as a reference to the international preliminary report on patentability (Chapter I) instead.

3. This report contains indications relating to the following items:

- | | | |
|-------------------------------------|--------------|---|
| <input checked="" type="checkbox"/> | Box No. I | Basis of the report |
| <input type="checkbox"/> | Box No. II | Priority |
| <input type="checkbox"/> | Box No. III | Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability |
| <input type="checkbox"/> | Box No. IV | Lack of unity of invention |
| <input checked="" type="checkbox"/> | Box No. V | Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement |
| <input type="checkbox"/> | Box No. VI | Certain documents cited |
| <input type="checkbox"/> | Box No. VII | Certain defects in the international application |
| <input type="checkbox"/> | Box No. VIII | Certain observations on the international application |

4. The International Bureau will communicate this report to designated Offices in accordance with Rules 44*bis*.3(c) and 93*bis*.1 but not, except where the applicant makes an express request under Article 23(2), before the expiration of 30 months from the priority date (Rule 44*bis*.2).

	Date of issuance of this report 17 July 2006 (17.07.2006)
The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No. +41 22 338 82 70	Authorized officer Agnes Wittmann-Regis e-mail: pt06@wipo.int

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

Absender: INTERNATIONALE RECHERCHENBEHÖRDE

REC'D 04 MAY 2005

PCT

WIPO

PCT

An:

siehe Formular PCT/ISA/220

SCHRIFTLICHER BESCHEID DER INTERNATIONALEN RECHERCHENBEHÖRDE (Regel 43bis.1 PCT)

Absendedatum

(Tag/Monat/Jahr) siehe Formular PCT/ISA/210 (Blatt 2)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts
siehe Formular PCT/ISA/220

WEITERES VORGEHEN
siehe Punkt 2 unten

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/000257

Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)
13.01.2005

Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)
15.01.2004

Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK
A01N43/90

Anmelder
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

1. Dieser Bescheid enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- ☒ Feld Nr. I Grundlage des Bescheids
- ☐ Feld Nr. II Priorität
- ☐ Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- ☐ Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- ☒ Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Regel 43bis.1(a)(i) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- ☐ Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen
- ☐ Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- ☐ Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

2. WEITERES VORGEHEN

Wird ein Antrag auf internationale vorläufige Prüfung gestellt, so gilt dieser Bescheid als schriftlicher Bescheid der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde ("IPEA"); dies trifft nicht zu, wenn der Anmelder eine andere Behörde als diese als IPEA wählt und die gewählte IPEA dem Internationale Büro nach Regel 66.1bis b) mitgeteilt hat, daß schriftliche Bescheide dieser Internationalen Recherchenbehörde nicht anerkannt werden.

Wenn dieser Bescheid wie oben vorgesehen als schriftlicher Bescheid der IPEA gilt, so wird der Anmelder aufgefordert, bei der IPEA vor Ablauf von 3 Monaten ab dem Tag, an dem das Formblatt PCT/ISA/220 abgesandt wurde oder vor Ablauf von 22 Monaten ab dem Prioritätsdatum, je nachdem, welche Frist später abläuft, eine schriftliche Stellungnahme und, wo dies angebracht ist, Änderungen einzureichen.

Weitere Optionen siehe Formblatt PCT/ISA/220.

3. Nähere Einzelheiten siehe die Anmerkungen zu Formblatt PCT/ISA/220.

Name und Postanschrift der mit der internationalen
Recherchenbehörde



Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patentlaan 2
NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas
Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl
Fax: +31 70 340 - 3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Muellners, W

Tel. +31 70 340-3289



**SCHRIFTLICHER BESCHEID DER
INTERNATIONALEN RECHERCHEBEHÖRDE**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/000257

Feld Nr. I Grundlage des Bescheids

1. Hinsichtlich der **Sprache** ist der Bescheid auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache erstellt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
 - ☐ Der Bescheid ist auf der Grundlage einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache erstellt worden, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (gemäß Regeln 12.3 und 23.1 b)).
2. Hinsichtlich der **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz**, die in der internationalen Anmeldung offenbart wurde und für die beanspruchte Erfindung erforderlich ist, ist der Bescheid auf folgender Grundlage erstellt worden:
 - a. Art des Materials
 - ☐ Sequenzprotokoll
 - ☐ Tabelle(n) zum Sequenzprotokoll
 - b. Form des Materials
 - ☐ in schriftlicher Form
 - ☐ in computerlesbarer Form
 - c. Zeitpunkt der Einreichung
 - ☐ in der eingereichten internationalen Anmeldung enthalten
 - ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht
 - ☐ bei der Behörde nachträglich für die Zwecke der Recherche eingereicht
3. ☐ Wurden mehr als eine Version oder Kopie eines Sequenzprotokolls und/oder einer dazugehörigen Tabelle eingereicht, so sind zusätzlich die erforderlichen Erklärungen, daß die Information in den nachgereichten oder zusätzlichen Kopien mit der Information in der Anmeldung in der eingereichten Fassung übereinstimmt bzw. nicht über sie hinausgeht, vorgelegt worden.
4. Zusätzliche Bemerkungen:

**SCHRIFTLICHER BESCHEID DER
INTERNATIONALEN RECHERCHEBEHÖRDE**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/000257

**Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Regel 43*bis*.1(a)(i) hinsichtlich der Neuheit, der
erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur
Stützung dieser Feststellung**

1. Feststellung

Neuheit	Ja: Ansprüche 1-10 Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit	Ja: Ansprüche 1-10 Nein: Ansprüche
Gewerbliche Anwendbarkeit	Ja: Ansprüche: 1-10 Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

Zu Punkt V.

Es wird auf die folgenden im internationalen Recherchenbericht zitierten
Entgegenhaltungen (D1-D7) verwiesen:

D1: US-B1-6 268 371

D2: WO 98/46607 A

D3: YASUO YAMADA: "MONCEREN® (Pencycuron) a New Fungicide", JAPAN
PESTICIDE INFORMATION, JAPAN PLANT PROTECTION ASSOCIATION,
TOKYO,, JP, No. 48, 1986, Seiten 16-22, ISSN: 0368-265X

D4: EP-A-0 988 790

D5: US-A-5 593 996

D6: WO 99/48365 A

D7: DATABASE WPI Section Ch, Week 198734 Derwent Publications Ltd., London,
GB; Class C01, AN 1987-238749 & JP 62 161704 A

Neuheit

Die vorliegende Anmeldung erfüllt das Erfordernis des Artikels 33(1) PCT in Verbindung
mit Artikel 33(2) PCT, weil der Gegenstand der Ansprüche 1-10 neu ist.

Gegenstand des unabhängigen Anspruches 1 ist eine fungizide Mischung aus Pencycuron
und einem spezifischen fungiziden Triazolopyrimidin (im folgenden TP1 genannt) in einer
synergistisch wirksamen Menge. Die übrigen unabhängigen Ansprüche 4, 9 und 10 richten
sich auf ein Verfahren zur Bekämpfung von reispflichtigen Schädlingen mittels einer
solchen Mischung, auf aus einem solchen Verfahren resultierendes Saatgut, das eine
solche Mischung enthält, bzw. auf die Verwendung der beiden Verbindungen zur
Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von reispflichtigen Schädlingen.

D1 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen)
synergistische Mischungen von unter anderem aus D4 bekannten Triazolopyrimidinen mit
Melaninbiosynthesehemmern wie Carpropamid, Pyroquilon und Fenoxanil. Diese
Mischungen sind insbesondere wirksam gegen Reispflichtige (*Pyricularia oryzae*,
Rhizoctonia solani und *Cochliobolus miyabeanus*, der die Braunfleckenkrankheit
verursacht). Die bevorzugten in D1 als Azolopyrimidine A, C und D bezeichneten (im
Folgenden TPa, TPb bzw. TPc genannt) Triazolopyrimidine sind das 6-(2-Cl-6-F-Phenyl)-,

das 7-(2,2,2-Trifluorethylamino)- bzw. das 7-(1,1,1-Trifluoropropyl-2-yl-amino)-Analoge des TP1.

D2 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) u.a. spezifisch die Verbindung TP1 (Beispielverbindung 2). Die Verbindung wird hinsichtlich ihrer Wirkung gegen echten Mehltau auf Weintrauben mit TPa verglichen und überlegen gefunden. Die Möglichkeit der Mischung mit anderen Fungiziden, unter denen auch Pencycuron aufgeführt wird, unter Umständen unter Erzielung eines synergistischen Effektes, wird erwähnt aber nicht realisiert.

D3 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) das Pencycuron sehr wirksam gegen *Rhizoctonia solani* (*Corticium sasakii*, perfektes Stadium: *Thanatephorus cucumeris*) auf Reis ist, aber auch das es in dieser Hinsicht ausgesprochen spezifisch ist und gegen *Pyricularia oryzae* kaum Wirkung zeigt.

D4 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) synergistische Mischungen von Triazolopyrimidinen einer allgemeinen Formel, unter die auch TP1 fällt, mit 22 anderen Fungiziden bzw. Fungizidklassen, unter ihnen aber nicht Pencycuron. Die bevorzugten und in Beispielen benutzten Azolopyrimidine A, B und C sind die oben genannten TPa, TPb bzw. TPc.

D5 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) bestimmte fungizide Triazolopyrimidine, darunter TPa. Die Wirkung gegen *Pyricularia oryzae* auf Reis wird demonstriert (siehe D5, Beispiele 225 und 226).

D6 offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) Mischungen von Oximether-Strobilurinen, wie z.B. das Reisfungizid Orysastrobin, mit verschiedenen gegen *Rhizoctonia* wirksamen Fungiziden, darunter Pencycuron. Die Mischungen erweisen sich als synergistisch wirksam gegen *Pyricularia oryzae*.

D7 schließlich offenbart (siehe die im internationalen Recherchenbericht zitierten Passagen) Mischungen von Cyclopropancarboxamiden, wie z.B. Carpropamid, die gute Wirksamkeit gegen *Pyricularia oryzae* aber nur geringe Wirkung gegen *Pellicularia sasakii* (Anamorph *Rhizoctonia solani*) zeigen, mit Pencycuron. Die Mischung zeigt einen

synergistischen Effekt und ein breiteres fungizides Spektrum.

somit offenbart keine der genannten Entgegenhaltungen die spezifische Mischung, die Gegenstand der vorliegenden Anmeldung ist.

Erfinderische Tätigkeit

Die vorliegende Anmeldung erfüllt die Erfordernisse des Artikels 33(1) PCT in Verbindung mit Artikel 33(3) PCT, weil der Gegenstand der Ansprüche 1-10 auf einer erfinderischen Tätigkeit beruht.

Im Lichte der Beschreibung und des nächsten Standes der Technik der Entgegenhaltung D1 kann als die der Anmeldung zugrundeliegende Aufgabe die Bereitstellung synergistischer Mischungen von Triazolopyrimidinen mit anderen Fungiziden angesehen werden, die sich zur Bekämpfung von Reispfaden eignen, das heißt, die eine hohe Systemik mit einer guten Wirksamkeit gegen *Pyricularia oryzae* und *Rhizoctonia solani* vereinen.

Die vorgeschlagene Lösung ist durch die Verwendung des spezifischen Triazolopyrimidins TP1 in Kombination mit Pencycuron gekennzeichnet.

Der nächste Stand der Technik D1 schlägt zur Lösung der gleichen Aufgabe vor (siehe oben) bestimmte 2,4,6-Trifluorphenyl-triazolopyrimidine in Kombination mit bekannten Melaninbiosynthesehemmern zu verwenden.

Die in der vorliegenden Anmeldung vorgeschlagene Lösung unterscheidet sich sowohl hinsichtlich des gewählten Triazolopyrimidins (TP1) als auch hinsichtlich des gewählten Mischungspartners (Pencycuron).

Aus D2 ist bekannt, dass TP1 und ähnliche Triazolopyrimidine sehr gute Wirksamkeit gegen die Reispfaden *Pyricularia grisea* f. sp. *oryzae* (Teleomorph: *Magnaporthe* gr. f. sp. *oryzae*) und *Rhizoctonia solani* zeigen. Es wird auf die Entgegenhaltung D5 als eine frühere Veröffentlichung dieser allgemeinen Substanzklasse verwiesen und angemerkt, dass die in D2 ausgewählten Verbindungen eine erhöhte Systemik und Wirksamkeit gegen Reiserkrankungen haben, dies offenbar im Vergleich zu den in D5 spezifisch genannten

Verbindungen. Außerdem wird eine Mischung mit anderen Fungiziden vorgeschlagen, die möglicherweise zu einem synergistischen Effekt führen könne.

In D4 werden Mischungen von Triazolopyrimidinen einer allgemeinen Formel, die sowohl TPa, TPb und TPc als auch TP1 umfasst, mit anderen Fungiziden offenbart (siehe oben). Tatsächlich verwendet werden aber nur die aus Entgegenhaltungen D1 und D5 bekannten TPa, TPb und TPc und Pencycuron ist nicht unter den gewählten Mischungspartnern. Getestet werden die synergistischen Mischungen auf einer Anzahl von Schadpilzen, wie Arten der Gattungen *Blumeria*, *Botrytis*, *Septoria*, *Erysiphe* und *Puccinia*, nicht aber auf eines der typischen Reispfathogene. Auch werden die Tests auf verschiedenen Nutzpflanzen, wie Weizen, Gerste, Äpfel, Gurken, Tomaten und Weinreben nicht aber Reis vorgenommen.

Dass Pencycuron wirksam gegen reispfathogene Pilze und insbesondere gegen *Rhizoctonia solani* ist, war aus dem Stand der Technik (D3, siehe oben) bekannt.

Als Mischungspartner für das Pencycuron werden andererseits im Stand der Technik Strobilurine, wie Oryastrobin (D6), bzw. Melaninbiosynthesehemmer, wie Carpropamid (D7) vorgeschlagen.

Angesichts dieses Standes der Technik war es keine offensichtliche Maßnahme, ausgehend von D1 in den dort offenbarten Mischungen TPa, TPb oder TPc durch TP1 und gleichzeitig die Melaninbiosynthesehemmer durch das strukturell völlig verschiedene Pencycuron zu ersetzen, oder andererseits ausgehend von D6 oder D7 die Strobilurine bzw. Melaninbiosynthesehemmer durch das strukturell völlig verschiedene TP1 zu ersetzen,

Noch viel weniger hätte der Fachmann erwartet, dass eine solche Mischung auch einen synergistischen Effekt gegenüber *Pyricularia oryzae* zeigen würde, wie es in der vorliegenden Anmeldung demonstriert wird.

Die vorgeschlagene Lösung ist deshalb nicht naheliegend sondern beruht auf einer erfinderischen Tätigkeit.

Industrielle Anwendbarkeit

**SCHRIFTLICHER BESCHEID
DER INTERNATIONALEN
RECHERCHEBEHÖRDE (BEIBLATT)**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/000257

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 wird als industriell anwendbar erachtet (Artikel 33(1) and (4) PCT).